

NOVEL FLUOROURACIL DERIVATIVE

Patent number: JP55059173
Publication date: 1980-05-02
Inventor: ITABASHI KUNIO
Applicant: KAKEN PHARMACEUT CO LTD
Classification:
- international: C07D239/54
- european:
Application number: JP19780131480 19781027
Priority number(s):

BEST AVAILABLE COPY**Abstract of JP55059173**

NEW MATERIAL: A 5-fluorouracil derivative of the formula (Y is SO₃, CO₂, or SO₂).

EXAMPLE: A 5-fluorouracil-m-formylbenzene-sulfonate.

USE: Decomposable into each component in vivo, and with both the physiological in actions of 5-fluorouracil and benzaldehyde or its devivative, particularly a carcinostatic. Administrable orally and easily preparable.

PROCESS: 5-Fluorouracil is dissolved in a slightly polar solvent, e.g. benzene, toluene, cyclohexane, or dichloroethane, and reacted with sulfonic, corboxylic or sulfinic acid derivative of formylbenzene to give the objective compound of formula I.

Data supplied from the esp@cenet database - Patent Abstracts of Japan

⑪ 日本国特許庁 (JP)

① 特許出願公開

⑫ 公開特許公報 (A)

昭55—59173

⑬ Int. Cl.³
C 07 D 239/54
// A 61 K 31/505

識別記号

庁内整理番号
6670—4C

⑭ 公開 昭和55年(1980)5月2日

発明の数 1
審査請求 未請求

(全 2 頁)

⑮ 新規な5-フルオロウラシル誘導体

国立市東2の27の8

⑯ 特 願 昭53—131480

⑰ 出 願 人 科研化学株式会社

⑱ 出 願 昭53(1978)10月27日

東京都文京区本駒込2の28の8

⑲ 発 明 者 板橋国夫

⑳ 代 理 人 弁理士 小林正雄

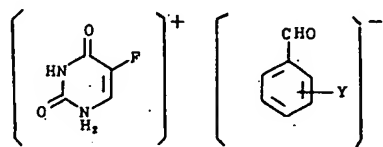
明 細 書

発明の名称

新規な5-フルオロウラシル誘導体

特許請求の範囲

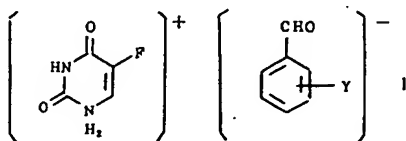
一般式



(式中 Y は基 SO₂、CO₂ 又は SO₃ を示す) で表わされる 5-フルオロウラシル誘導体。

発明の詳細な説明

本発明は、治療上有用な一般式



(式中 Y は基 SO₂、CO₂ 又は SO₃ を示す) で表わされる 5-フルオロウラシルの新規な塩に関する。

式 I の化合物は、次のようにして製造することができる。ベンズアルデヒドのフェニル核に直接又はメチレン基を介してプレnstテッド酸型の酸性基を結合させた化合物、例えばホルミルベンゼンスルホン酸、一カルボン酸又は一スルフィン酸は、極性の小さい溶媒、例えばベンゼン、トルエン、シクロヘキサン、ジクロルエタンなどに溶解した 5-フルオロウラシルと反応し、式 I のイソ尿素型の塩を形成して沈殿する。この反応は通常は室温に放置するだけで進行し、ほぼ定量的収率で目的物質を生成する。

式 I の新規化合物は生体内で各成分に分解し、5-フルオロウラシル及びベンズアルデヒドもしくはベンズアルデヒド誘導体の両方の生理作用を示し、特に抗癌剤として有用である。ウラシル誘導体の抗癌作用は公知である。ベンズアルデヒドも優れた抗癌作用を示しかつ毒性がき

わめて低く、しかも速かに生体外に排泄されるので副作用を生じない物質である（特開昭52-108027号公報参照）。

本発明の化合物は経口投与することができ、しかも粉末状であるため他の薬剤、補助剤などと混合し、種々の剤形の製剤に容易に加工できる利点を有する。

実施例

トルエン100 mlにm-ホルミルベンゼンスルホン酸1.86 g (0.01モル)を溶解し、5-フルオロウラシル1.3 g (0.01モル)のトルエン溶液に加えて室温に放置する。析出した結晶を5時間真空乾燥すると、融点135~145℃の5-フルオロウラシル-m-ホルミルベンゼンスルホン酸塩が得られる。収率は定量的である。

出願人 科 研 化 学 株 式 会 社
代理人 弁 理 士 小 林 正 雄